

R U 2 0 0 7 1 3 2 9 7 5 A

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ



(19) RU (11) 2007 132 975⁽¹³⁾ A

(51) МПК
A61K 9/20 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2007132975/15, 06.02.2006

(30) Конвенционный приоритет:
04.02.2005 DE 102005005446.3

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2009 Бюл. № 11

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 04.09.2007

(86) Заявка РСТ:
EP 2006/001027 (06.02.2006)

(87) Публикация РСТ:
WO 2006/082099 (10.08.2006)

Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег. № 11

(71) Заявитель(и):
ГРЮНЕНТАЛЬ ГМБХ (DE)

(72) Автор(ы):
АШУОРТ Джуди (DE),
АРКЕНАУ-МАРИЦ Элизабет (DE),
БАРТОЛОМОЙС Иоганнес (DE)

(54) СТОЙКИЕ К РАЗРУШЕНИЮ ФОРМЫ ПРИМЕНЕНИЯ С ЗАМЕДЛЕННЫМ
ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ ФИЗИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНОГО ВЕЩЕСТВА

(57) Формула изобретения

1. Форма применения, которая содержит физиологически активное вещество (A), необязательно одно или несколько физиологически совместимых вспомогательных веществ (B), синтетический или природный полимер (В) и необязательно природный, полусинтетический или синтетический воск (Г) и обладает сопротивлением разрушению по меньшей мере 400 Н и которая в физиологических условиях по истечении 5 ч высвобождает максимум 99% физиологически активного вещества (A) и не содержит ни трамадола гидрохлорид, ни оксикодона гидрохлорид.

2. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она не содержит обладающее психотропным действием вещество.

3. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она обладает сопротивлением разрушению по меньшей мере 500 Н.

4. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она представлена в виде таблетки.

5. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она представлена в дисперсном виде с сопротивлением отдельных частиц разрушению по меньшей мере 400 Н.

6. Форма применения по п.5, отличающаяся тем, что частицы спрессованы в

R U 2 0 0 7 1 3 2 9 7 5 A

таблетки или расфасованы в капсулы.

7. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что полимер (В) выбран из группы, включающей полиалкиленоксид, полиэтилен, полипропилен, поливинилхлорид, поликарбонат, полистирол, полиакрилат, их сополимеры и их смеси.

8. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что полимер (В) представляет собой полиалкиленоксид, выбранный из группы, включающей полиметиленоксид, полиэтиленоксид, полипропиленоксид, их сополимеры, их блоксополимеры и их смеси.

9. Форма применения по п.7, отличающаяся тем, что полимер (В) имеет средневязкостную молекулярную массу по меньшей мере $0,5 \cdot 10^6$ г/моль.

10. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она имеет оболочковую часть (82) и расположенную внутри нее сердцевину (83), с которой оболочковая часть (82) соединена бесшовно, при этом образующий оболочковую часть (82) материал и образующий сердцевину (83) материал имеют в основном одинаковый химический состав, но разную морфологию.

11. Форма применения по п.10, отличающаяся тем, что образующий оболочковую часть (82) материал и образующий сердцевину (83) материал обладают разными оптическими свойствами.

12. Форма применения по п.10, отличающаяся тем, что толщина слоя оболочковой части (82) составляет от 0,1 до 4 мм.

13. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что ее объем при хранении в течение по меньшей мере 12 ч при температуре на 20°C ниже температуры плавления смеси компонента (А), компонента (В), возможно используемого компонента (Б) и возможно используемого компонента (Г) увеличивается не более чем на 20%.

14. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что она содержит по меньшей мере один воск (Г) с температурой размягчения по меньшей мере 50°C.

15. Форма применения по п.14, отличающаяся тем, что воск (Г) представляет собой карнаубский воск или пчелиный воск.

16. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что физиологически активное вещество присутствует в замедляющей его высвобождение матрице.

17. Форма применения по п.16, отличающаяся тем, что полимер (В) и/или возможно присутствующий воск (Г) также служит/служат материалом, образующим замедляющую высвобождение физиологически активного вещества матрицу.

18. Форма применения по п.1, отличающаяся тем, что физиологически активное вещество (А) представляет собой лекарственное вещество, выбранное из группы, включающей средства для лечения и предупреждения заболеваний пищеварительного тракта и заболеваний, связанных с нарушением обмена веществ, средства для лечения и предупреждения заболеваний крови и кроветворных органов, средства для лечения и предупреждения заболеваний сердечно-сосудистой системы, средства для лечения заболеваний кожи, средства для лечения и предупреждения заболеваний уrogenитальных органов и половые гормоны, гормональные препараты для системного применения, исключая половые гормоны и инсулины, противомикробные средства для системного применения, противоопухолевые средства и иммуномодуляторы, средства для лечения и предупреждения заболеваний костно-мышечной системы, средства для лечения и предупреждения заболеваний нервной системы, противопаразитарные средства, инсектициды и репелленты, средства для лечения и предупреждения заболеваний дыхательного тракта, средства для лечения и предупреждения заболеваний органов чувств, общие диететические средства и радиотерапевтические средства.

19. Способ приготовления формы применения по одному из пп.1-18, заключающийся в том, что

(а) смешивают между собой компонент (А), возможно используемый компонент (Б), компонент (В) и возможно используемый компонент (Г),

(б) полученную на стадии (а) смесь при необходимости подвергают предварительному формированию, предпочтительно путем теплового воздействия на нее и/или путем приложения к ней усилия, при этом количества подводимого тепла предпочтительно должно быть недостаточно для нагрева компонента (В) до температуры его размягчения,

(в) смеси дают затвердеть путем теплового воздействия на нее и путем приложения к ней усилия с подводом при этом к смеси тепла во время и/или до приложения к ней усилия в количестве, достаточном для нагрева компонента (В) по меньшей мере до температуры его размягчения,

(г) затвердевшую смесь при необходимости разделяют на отдельные части,

(д) при необходимости формуют форму применения и

(е) при необходимости наносят на нее пленочное покрытие.

20. Способ по п.19, отличающийся тем, что на стадии (в) используют двухчертвячный экструдер или планетарно-вальцовый экструдер.

21. Способ по п.20, отличающийся тем, что стадию (д) проводят в пластицированном состоянии смеси компонента (А), компонента (В), возможно используемого компонента (Б) и возможно используемого компонента (Г).

22. Способ по одному из пп.19-21, отличающийся тем, что стадию (в) проводят при воздействии на смесь ультразвуком.

23. Продукт, получаемый способом по одному из пп.19-22.

24. Применение физиологически активного вещества (А) и/или синтетического или природного полимера (В) для приготовления формы применения по одному из пп.1-18, предназначеннной для профилактики и/или лечения заболевания, с предотвращением передозировки физиологически активного вещества (А), прежде всего вследствие измельчения формы применения путем механического воздействия на нее.

25. Применение физиологически активного вещества (А) и/или синтетического или природного полимера (В) для приготовления формы применения по одному из пп.1-18 с предотвращением непреднамеренного нарушения, прежде всего устранения, эффекта замедленного высвобождения из нее физиологически активного вещества (А) вследствие измельчения формы применения путем механического воздействия на нее.

26. Применение формы применения по одному из пп.1-18 для приготовления медикамента, предназначенного для профилактики и/или лечения заболевания, с предотвращением передозировки физиологически активного вещества (А), прежде всего вследствие измельчения медикамента путем механического воздействия на него.

27. Применение формы применения по одному из пп.1-18 для приготовления медикамента, предназначенного для профилактики и/или лечения заболевания, с предотвращением непреднамеренного нарушения, прежде всего устранения, эффекта замедленного высвобождения из него физиологически активного вещества (А) вследствие измельчения медикамента путем механического воздействия на него.

28. Применение по одному из пп.24-27, отличающееся тем, что механическое воздействие выбрано из группы, включающей разжевывание, растирание в ступке, нанесение ударов молотком и использование специальных устройств для измельчения в порошок традиционных форм применения.